

## USE OF CAMPHOR DERIVATIVE FOR ATTAINING OR INCREASING SOLUBILITY OF TRIAZINE DERIVATIVE IN OIL COMPONENT

**Publication number:** JP10087470

**Publication date:** 1998-04-07

**Inventor:** GERS-BARLAG HEINRICH DR; KROEPKE RAINER

**Applicant:** BEIERSDORF AG

**Classification:**

- international: **A61K8/30; A61K8/00; A61K8/06; A61K8/35; A61K8/49; A61K8/92; A61Q17/04; A61K8/00; A61K8/04; A61K8/30; A61K8/92; A61Q17/04; (IPC1-7): A61K7/42; A61K7/00**

- European: **A61K8/06; A61K8/06F; A61K8/35; A61K8/49F4; A61Q17/04**

**Application number:** JP19970227057 19970811

**Priority number(s):** DE19961033012 19960816

**Also published as:**



EP0824913 (A2)

EP0824913 (A3)

DE19633012 (A1)

[Report a data error here](#)

### Abstract of **JP10087470**

**PROBLEM TO BE SOLVED:** To improve the solubility and dispersibility of a compound low in solubility in an oil component and an oil phase and to stabilize the compound by using a camphor derivative.

**SOLUTION:** In order to attain or increase the solubility of (C) 4,4',4''-(1,3,5- triazine-2,4,6-tyltriimino) trisbenzoic acid.tris(2-ethylhexyl) which is an UVB filter in any of at least one oil phase of a two phase or a multiphase system dispersed in (A) an independent oil component or (B) an aqueous phase, (D) a camphor derivative of the formula (R is an aryl which is substituted with a  $\leq 5$ C alkyl or nonsubstituted) is added. Consequently, a cosmetic for treating skin and a light-protecting prepared substance of dermatologic science in which an active compound is excellently dissolved or dispersed can be obtained.

Data supplied from the **esp@cenet** database - Worldwide

(19) 日本国特許庁 (J P)

(12) 公開特許公報 (A)

(11) 特許出願公開番号

特開平10-87470

(43) 公開日 平成10年(1998) 4月7日

(51) Int.Cl.<sup>6</sup>

識別記号

F I

A 6 1 K 7/42

A 6 1 K 7/42

7/00

7/00

C

D

審査請求 未請求 請求項の数2 F D (全 12 頁)

(21) 出願番号 特願平9-227057

(22) 出願日 平成9年(1997) 8月11日

(31) 優先権主張番号 1 9 6 3 3 0 1 2. 2

(32) 優先日 1996年8月16日

(33) 優先権主張国 ドイツ (DE)

(71) 出願人 591010376

バイヤースドルフ・アクチエンゲゼルシャ  
フトBEIERSDORF AKTIENGE  
SELLSCHAFTドイツ連邦共和国デー-20245ハンブル  
ク・ウンナシユトラ-セ48

(72) 発明者 ハインリヒ・ゲルス-バルラー

ドイツ・デー-25495クマーフェルト・キ  
ービツツグルント11

(72) 発明者 ライナー・クレブケ

ドイツ・デー-22527ハンブルク・シユテ  
リンガーダム34アー

(74) 代理人 弁理士 小田島 平吉

(54) 【発明の名称】 油成分中におけるトリアジン誘導体の溶解度を達成又は増加させるための、カンファー誘導体の使用

(57) 【要約】

【課題】 油成分中で溶解度の高まったトリアジン誘導体を含有する組成物の提供。

【解決手段】 (a) 孤立した油成分中、又は (b)

更に1種類以上の水性相を含んでなることができる、分散された二相もしくは多相系の少なくとも1種類の油性相中のいずれかへの、4, 4', 4'' - (1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ) トリス安息香酸・トリス (2-エチルヘキシル) の溶解度を達成又は増加させるためのカンファー誘導体の使用。

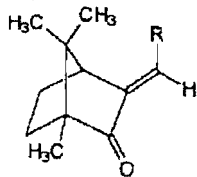
## 【特許請求の範囲】

【請求項1】 (a) 独立した油成分中、又は(b)

更に1種類以上の水性相を含んでなることができる、分散された二相もしくは多相系の、少なくとも1種類の油性相中、のいずれかにおいて、4, 4', 4''-

(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ) トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)の溶解度を達成又は増加させるための、一般構造

【化1】



[式中、Rは5個までのアルキル基により置換されているか又は非置換のアリール基である]のカンファ-誘導体の使用。

【請求項2】 (a) 孤立した油成分中、又は(b)

更に1種類以上の水性相を含んでなることができる、分散された二相もしくは多相系の、少なくとも1種類の油性相中、のいずれかにおいて、4, 4', 4''-

(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ) トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)の溶液を安定化させる方法であって、本発明に従って使用される、活性量の1種類以上のカンファ-誘導体を、(a) その中に4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ) トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)が溶解形態で存在する、孤立した油成分中に、又は(b) その中に4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ) トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)が溶解形態で存在する、分散された二相もしくは多相系の、少なくとも1種類の油性相中、のいずれかに添加し、その際前記の二相もしくは多相系は更に1種類以上の水性相を含んでなることができる、ことを特徴とする方法。

## 【発明の詳細な説明】

【0001】

【発明の属する技術分野】本発明は、化粧品及び皮膚科学的な光線防御調製物、特に皮膚の手入れ用の、化粧品及び皮膚科学的な光線防御調製物に関する。

【0002】

【従来の技術】皮膚に対する太陽光線の紫外線部分の損傷の効果は一般に知られている。290nm未満の波長(いわゆるUVC域)をもつ光線は、地球の大気中のオゾン層により吸収されるが、290nmと320nmの間の領域、いわゆるUVB域の光線は、紅斑、軽い日焼け又は重度もしくは軽度の熱傷すら引き起こす。

【0003】308nm周辺の比較的狭い領域は、太陽

光線の紅斑活性最大域と称されている。

【0004】通常、3-ベンジリデンカンファ-、4-アミノ安息香酸、ケイ皮酸、サリチル酸、ベンゾフェノンあるいはまた2-フェニルベンズイミダゾールの誘導体である多数の化合物は、UVB光線に対する防御物質として知られている。

【0005】約320nmと約400nmの間の領域の光線もまた損傷を引き起こす可能性があるため、それらの間の領域、いわゆるUVA域に対して有効なフィルター物質をもつこともまた重要である。このように、UVA光線は、皮膚を早期に老化させる、結合組織の弾性繊維及びコラーゲン繊維に損傷をもたらすこと、及びそのことが、幾多の光線毒性反応及び光線アレルギー反応の一因とみなすことができること、が判明した。UVB光線の損傷的影響はUVA光線により増強されるかもしれない。

【0006】しかし、UV光線はまた光化学反応に導く可能性があり、次いでその光化学反応生成物が皮膚代謝に介入する。

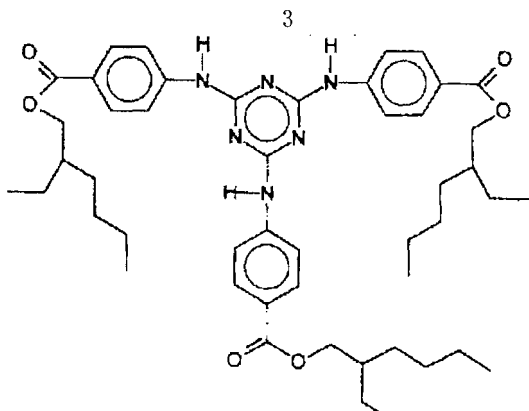
【0007】このような光化学反応生成物は主としてフリーラジカル化合物、例えばヒドロキシルラジカルである。皮膚自体の中で生成される、未確定のフリーラジカルの光化学生成物もまた、それらの高い反応性による、制御されない二次反応を示す可能性がある。しかし、非ラジカルの励起状態の酸素分子である、一重項酸素は、寿命の短いエボキシド及び幾多のその他の物質のように、UV照射下で存在するかもしれない。例えば一重項酸素は、増加した反応性によって、正常に存在する三重項酸素(フリーラジカルの基底状態)と区別される。しかしながら、励起された、反応性の(フリーラジカルの)三重項状態の酸素分子もまた存在する。

【0008】UV光線は更にイオン化光線の仲間と考えられる。従って、UV曝露中にイオン性の物質が生成される危険性もあり、次いでそれらが順次、生化学過程において酸化的に介入する可能性がある。

【0009】1種類の好都合なUVBフィルターは4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ) トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)、同義語: 2, 4, 6-トリス-[アニリノ-(p-カルボ-2'-エチル-1'-ヘキシルオキシ)]-1, 3, 5-トリアジンである。

【0010】

【化2】



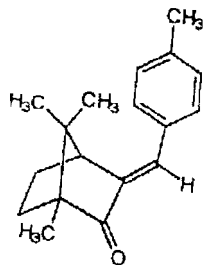
【0011】このUVBフィルター物質は BASF Aktien gesellschaft 社により UVINUL<sup>®</sup> T150 の商品名で市販されており、良好なUV吸収性を特徴とする。

【0012】このUVBフィルターの主な欠点は、脂質に対するその低い溶解度である。このUVBフィルターのための既知の溶媒は、このフィルターを最大約15重量%溶解させることができ、これは溶解された、そして従って活性なUVフィルター物質の約1～1.5重量%に相当する。

【0013】既知のそして従来からの光線防御フィルター物質は更に、構造

【0014】

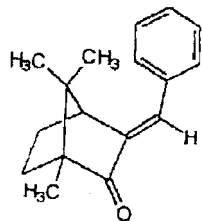
【化3】



【0015】を特徴とし、そして商品名 Eusolex<sup>®</sup> 6300として Merck社から市販されている、4-メチルベンジリデンカンファー、並びに構造

【0016】

【化4】



【0017】を特徴とし、そして商品名 Unisol<sup>®</sup> S22として Induchem社から市販されているベンジリデンカンファーである。

【0018】しかし、従来からの当該技術の欠点は、概して比較的低い光線防御因子のみを達成することができる点、あるいは光線防御フィルターが適宜なUV安定性を有しないかあるいは、適宜な生理学的許容性を有しない

か、あるいは化粧品又は皮膚科学的調製物中での十分に高い溶解度又は分散性を有しないかあるいはまた、化粧品又は皮膚科学的調製物とのその他の不相容性又は幾つかの欠点を同時に有する点であった。

【0019】

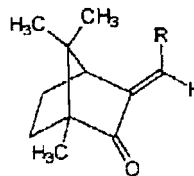
【発明が解決しようとする課題】これらの欠点の、全部とは言えないまでも、少なくともその幾つかを是正することが本発明の目的の一つであった。

【0020】

- 10 【発明の構成】しかし、(a) 孤立した油成分中、又は(b) 更に1種類以上の水性相を含んでなることができる、分散された二相もしくは多相系の少なくとも1種類の油性相中、のいずれかにおいて、4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ)トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)の溶解度を達成又は増加させるための、一般構造

【0021】

【化5】



【0022】[式中、Rは5個までのアルキル基により置換されているか又は非置換のアリール基である]のカンファー誘導体の使用が、従来からの当該技術の欠点を是正することは驚くべきことであり、当業者に予知できなかった。

- 30 【0023】本発明によると、カンファー誘導体もしくは誘導体類は好ましくはベンジリデンカンファー及び4-メチルベンジリデンカンファーからなる群から選ばれる。

【0024】カンファー誘導体もしくは誘導体類が本発明に従って使用される場合、比較的低い成分4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ)トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)は、従来からの当該技術の調製物中におけるよりも、(a) 孤立した油成分中、又は(b)

- 40 更に1種類以上の水性相を含んでなることができる、分散された二相もしくは多相系の少なくとも1種類の油性相中のいずれかにおいて、有意に良好な溶解度を有する。

【0025】本発明によると、更に1種類以上の水性相を含んでなることができる、分散された二相もしくは多相系を、化粧品又は皮膚科学的エマルジョン、例えばW/O、O/W、W/O/W又はO/W/O型のエマルジョンの形態に組成することが好ましい。

【0026】孤立した形態でもあるいは、更に1種類以上の水性相を含んでなることができる、分散された二相

もしくは多相系の、少なくとも1種類の油性相中でもどちらにおいても、油成分の1種類として、主要な油成分として、又は唯一の油成分として、ジカプリリルエーテル又はそれに匹敵する物質を選択する場合ですら、問題の系における4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ)トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)の溶解度は著しく増加する。

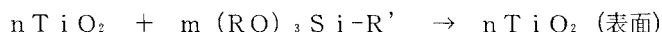
【0027】従来の当該技術から期待できるものよりも、より高い安定性、なかでも光線、特にUV光線の影響下での分解に対する安定性を有する光線防御調製物が、更に本発明により得られる。特に良好な皮膚許容性をもつ調製物が更に本発明により得られる。

【0028】それらが基礎とする物質の、化粧品及び皮膚科学的許容性はもちろん、本発明に従う目的のための、本発明による活性化合物組み合わせ物の有用性のための必要条件である。

【0029】本発明によると、従来の当該技術に比較して、化粧品又は皮膚科学的調製物中に使用される、4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ)トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)の量を、例えば2倍にすることが可能である。

【0030】更に、4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ)トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)は通常、溶解度が低いのみならず、またその溶液から再結晶し易いため、本発明によるカンファー誘導体の添加により、特にベンジリデンカンファー及び/又は4-メチルベンジリデンカンファーの添加により、(a) 孤立した油成分中、又は(b) 更に1種類以上の水性相を含んでなることができる、分散された二相もしくは多相系の少なくとも1種類の油性相中の、いずれかにおける、4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ)トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)溶液の安定化がもたらされることは驚くべきことであった。

【0031】従って本発明はまた、(a) 孤立した油成分中、又は(b) 更に1種類以上の水性相を含んでなることができる、分散された二相もしくは多相系の少なくとも1種類の油性相中の、いずれかにおいて、4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ)トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)の溶液を安定化させる方法に関し、その方法は、本発明に従って使用される、活性量の、1種類以上のカンファー誘導体を、(a) その中で4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ)トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)が溶解形態で存在する、孤立した油成分中に、又は(b) その中で4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ)トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)が溶解形態で存在する、分散された二相もしくは多相系の少なくとも1種類の油性相中、のいずれかに添加し、その際、前記二相もしくは多相系は更に1種類以上の水性相を含んでなることができる、ことを特徴とする。



に従う反応により、疎水性の表面の層を生成することを含んでなる。この等式中、n及びmは所望のように使用することができる化学量論的パラメーターであり、そし

\* 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ)トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)が溶解形態で存在する、孤立した油成分中に、又は(b) その中で4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ)トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)が溶解形態で存在する、分散された二相もしくは多相系の少なくとも1種類の油性相中、のいずれかに添加し、その際、前記二相もしくは多相系は更に1種類以上の水性相を含んでなることができる、ことを特徴とする。

【0032】完成した化粧品又は皮膚科学的調製物中の4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ)トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)の総量は好都合には、調製物の総重量の0.1~10.0重量%、好ましくは0.5~6.0重量%の範囲から選ばれる。

【0033】完成した化粧品又は皮膚科学的調製物中の、本発明に従って使用される1種類以上のカンファー誘導体の総量は好都合には、調製物の総重量の0.1~15.0重量%、好ましくは0.5~8.0重量%の範囲から選ばれる。

【0034】4, 4', 4''-(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ)トリス安息香酸・トリス(2-エチルヘキシル)と、本発明に従って使用される1種類以上のカンファー誘導体の重量比を1:8から4:1、好ましくは1:4から2:1、特に好ましくは1:2から1:1の範囲から選ぶことが特に好都合である。

【0035】本発明による化粧品及び皮膚科学的調製物は、好都合には、更に、水に僅かに可溶性か、又は不溶性である金属酸化物及び/又はその他の金属化合物、特にチタンの酸化物( $TiO_2$ )、亜鉛の酸化物( $ZnO$ )、鉄の酸化物(例えば、 $Fe_2O_3$ )、ジルコニウムの酸化物( $ZrO_2$ )、ケイ素の酸化物( $SiO_2$ )、マンガンの酸化物(例えば $MnO$ )、アルミニウムの酸化物( $Al_2O_3$ )及びセリウムの酸化物(例えば $Ce_2O_3$ )、対応する金属の混合酸化物並びにこれらの酸化物の混合物、を基礎にした無機顔料を含んでなる。特に好ましい顔料は $TiO_2$ を基にしたものである。

【0036】無機顔料が疎水性形態で存在する、すなわち、それらが表面上に撥水处理をほどこされていることは、本発明の範疇内で、必ずしも必須ではないが、特に好都合である。この表面処理はそれ自体既知の方法により、顔料に薄い疎水性の層を与えることを含んでなることができる。

【0037】このような方法は、例えば、

てR及びR'は所望の有機基である。ドイツ特許出願公開第33 14742号と同様に調製された疎水化顔料が好都合である。

【0038】好都合なTiO<sub>2</sub>顔料は、例えばTAYCA社からの商品名MT 100 T、及び更に、Kemira社からのM 160及びDegussa社からのT 805として入手できる。

【0039】本発明による化粧品及び／又は皮膚科学的光線防御調製物は通常の組成をもつことができ、そして化粧品及び／又は皮膚科学的光線防御のために、そして更に皮膚及び／又は毛髪の処置、手入れ及び清浄化のために、そして装飾化粧品におけるメイクアップ製品として使用することができる。

【0040】使用のために、本発明による化粧品及び皮膚科学的調製物は化粧品として通常の方法で、適量を、皮膚及び／又は毛髪に使用される。

【0041】日焼け止め用組成物の形態にある化粧品及び皮膚科学的調製物が特に好ましい。これらは好都合には更に、少なくとも1種類のその他のUVAフィルター及び／又は少なくとも1種類のその他のUVBフィルター及び／又は少なくとも1種類の無機顔料、好ましくは無機の微細顔料を含んでなることができる。

【0042】本発明による化粧品及び皮膚科学的調製物は、このような調製物中に通常使用されるような化粧品補助剤、例えば保存剤、殺バクテリア剤、香料、発泡抑制物質、染料、着色作用をもつ顔料、増粘剤、加湿剤及び／又は保湿物質、脂肪、油、ワックスあるいは、アルコール、ポリオール、ポリマー、気泡安定剤、電解質、有機溶媒又はシリコーン誘導体のような、化粧品又は皮膚科学的調製物のその他の通常の成分を含んでなることができる。

【0043】抗酸化剤を更に含有することは一般的に好ましい。本発明に従って使用することができる好ましい抗酸化剤は、化粧品及び／又は皮膚科学的使用に適宜な又はそのための従来からのすべての抗酸化剤である。

【0044】抗酸化剤は好都合には、非常に少量の許容投与量（例えばpmolからμmol/kg）における、アミノ酸（例えばグリシン、ヒスチジン、チロシン及びトリプトファン）及びそれらの誘導体、イミダゾール（例えばウロカニン酸）及びそれらの誘導体、D、L-カルノシン、D-カルノシン、L-カルノシン及びそれらの誘導体（例えばアンセリン）のようなペプチド、カロテノイド、カロテン（例えばα-カロテン、β-カロテン及びリコペン）及びそれらの誘導体、クロロゲン酸及びその誘導体、リボ酸及びその誘導体（例えばジヒドロリボ酸）、アウロチオグルコース、プロピルチオウラシル及びその他のチオール（例えばチオレドキシン、グルタチオン、システイン、シスチン、シスタミン並びに、それらのグリコシル、N-アセチル、メチル、エチル、プロピル、アミル、ブチル及びラウリル、パルミトイル、オレイル、γ-リノレイル、コレステリル及びグリセリルエステル）及びそれらの塩、チオジプロピオン酸ジラウリル、チオジプロピオン酸ジステアリル、チオジプロピオン酸及びその誘導体（エステル、エーテル、

ペプチド、脂質、ヌクレオチド、ヌクレオシド及び塩）及びスルホキシミン化合物（例えばブチオニースルホキシミン、ホモシステイニースルホキシミン、ブチオニースルホン並びにペンター、ヘキサー及びヘプタチオニースルホキシミン）、並びに更に、（金属）キレート化剤（例えばα-ヒドロキシ脂肪酸、パルミチン酸、フィチン酸及びラクtofエリン）、α-ヒドロキシ酸（例えばクエン酸、乳酸及びリンゴ酸）、フミン酸、胆汁酸、胆汁抽出物、ビリルビン、ビリベルジン、EDTA、EGTA及びそれらの誘導体、不飽和脂肪酸及びそれらの誘導体（例えばγ-リノレン酸、リノール酸及びオレイン酸）、葉酸及びその誘導体、フルフリリデンソルビトール及びその誘導体、ユビキノン及びユビキノール及びそれらの誘導体、ビタミンC及び誘導体（例えばパルミチン酸アスコルビル、リン酸アスコルビルMg及び酢酸アスコルビル）、トコフェロール及び誘導体（例えば酢酸ビタミンE）、ビタミンA及び誘導体（パルミチン酸ビタミンA）及びベンゾイン樹脂の安息香酸コニフェリル、ルチン酸及びその誘導体、α-グルコシルルチン、フェルラ酸、フルフリリデングルシトール、カルノシン、ブチルヒドロキシトルエン、ブチルヒドロキシアニソール、ノルジヒドログアヤク脂酸、ノルジヒドログアヤレチン酸、トリヒドロキシブチロフェノン、尿酸及びその誘導体、マンノース及びその誘導体、亜鉛及びその誘導体（例えばZnO及びZnSO<sub>4</sub>）、セレン及びその誘導体（例えばセレン・メチオニン）、スチルベン及びそれらの誘導体（例えば酸化スチルベン及び酸化トランススチルベン）、及び本発明により適宜な、前記の活性化合物の誘導体（塩、エステル、エーテル、糖、ヌクレオチド、ヌクレオシド、ペプチド及び脂質）からなる群から選ばれる。調製物中の前記の抗酸化剤（1種類以上の化合物）の量は好ましくは、調製物の総重量の0.001から30重量%、特に好ましくは0.05~20重量%、特に1~10重量%である。

【0045】ビタミンE及び／又はその誘導体が抗酸化剤もしくは抗酸化剤類である場合には、調製物の総重量の0.001~10重量%の範囲からそれらの具体的な濃度を選ぶことが好都合である。

【0046】ビタミンAもしくはビタミンA誘導体、又はカロテンもしくはそれらの誘導体が抗酸化剤もしくは抗酸化剤類である場合には、調製物の総重量の0.001~10重量%の範囲からそれらの具体的な濃度を選ぶことが好都合である。

【0047】脂質相は好都合には、下記の物質の群：

- 鉱油及び鉱物ワックス
- カプリン酸又はカプリル酸のトリグリセリドのような油、しかし好ましくはヒマシ油；
- 脂肪、ワックス及びその他の天然に存在する及び合成の脂肪物質、好ましくは低C数のアルコール、例えば

イソプロパノール、プロピレングリコール又はグリセロール、と脂肪酸のエステル、あるいは低C数のアルカン酸又は脂肪酸と、脂肪アルコールとのエステル；

ー 安息香酸アルキル；  
ー ジメチルポリシロキサン、ジエチルポリシロキサン、ジフェニルポリシロキサン及びそれらの混合形態のようなシリコン油から選ぶことができる。

【0048】本発明の範疇内のエマルジョン、オレオゲル又はヒドロ分散物もしくは脂質分散物の油性相は好都合には、3から30個のC原子の鎖長をもつ飽和及び／又は不飽和の、分枝状及び／又は非分枝状アルカンカルボン酸と、3から30個のC原子の鎖長をもつ飽和及び／又は不飽和の、分枝状及び／又は非分枝状アルコールとのエステルからなる群から、あるいは芳香族カルボン酸と、3から30個のC原子の鎖長をもつ、飽和及び／又は不飽和の、分枝状及び／又は非分枝状アルコールとのエステルからなる群から選ばれる。次にこのようなエステル油は好都合には、ミリスチン酸イソプロピル、パルミチン酸イソプロピル、ステアリン酸イソプロピル、オレイン酸イソプロピル、ステアリン酸n-ブチル、ラウリン酸n-ヘキシル、オレイン酸n-デシル、ステアリン酸イソオクチル、ステアリン酸イソノニル、イソノナン酸イソノニル、パルミチン酸2-エチルヘキシル、ラウリン酸2-エチルヘキシル、ステアリン酸2-ヘキシルデシル、パルミチン酸2-オクチルドデシル、オレイン酸オレイル、エルカ酸オレイル、オレイン酸エルシル及びエルカ酸エルシル及び、このようなエステルの、合成の、半合成の及び天然に存在する混合物、例えばジョジョバ油からなる群から選ぶことができる。

【0049】油性相は更に、好都合には、分枝状及び非分枝状炭化水素及びワックス、シリコン、ジアルキルエーテルからなる群、飽和又は不飽和の、分枝状又は非分枝状アルコール及び脂肪酸トリグリセリド、特に8から24個の、特に12~18個のC原子の鎖長をもつ、飽和及び／又は不飽和の、分枝状及び／又は非分枝状アルカンカルボン酸のトリグリセロールエステルからなる群から選ぶことができる。該脂肪酸トリグリセリドは好都合には、例えば、合成、半合成及び天然に存在する油、例えばオリーブ油、ヒマワリ油、大豆油、ピーナツ油、菜種油、アーモンド油、ヤシ油、ココナツ油、ヤシの芯油及びその他多数の油からなる群から選ぶことができる。

【0050】このような油及びワックス成分のあらゆる所望の混合物は、本発明の範疇内で好都合に使用できる。適当なら、油性相の唯一の脂質成分として、ワックス、例えばパルミチン酸セチルを使用することも好都合かも知れない。

【0051】油性相は好都合には、イソステアリン酸2-エチルヘキシル、オクチルドデカノール、イソノナン酸イソトリデシル、イソエイコサン、ココア酸2-エチ

ルヘキシル、安息香酸C<sub>12-15</sub>ーアルキル、カプリル酸／カプリン酸トリグリセリド及びジカプリリルエーテルからなる群から選ばれる。

【0052】安息香酸C<sub>12-15</sub>ーアルキルとイソステアリン酸2-エチルヘキシルの混合物、安息香酸C<sub>12-15</sub>ーアルキルとイソノナン酸イソトリデシルの混合物並びに、安息香酸C<sub>12-15</sub>ーアルキル、イソステアリン酸2-エチルヘキシル及びイソノナン酸イソトリデシルの混合物、が特に好都合である。

【0053】炭化水素のうちでは、パラフィン油、スクアラン及びスクアレンを本発明の範疇内で好都合に使用することができる。

【0054】シリコン油もしくはシリコン油類に加えて、その他の油性相成分の追加的含有物を使用することは好ましいが、油性相は更に、環状又は線状シリコン油を含有するかあるいはこのような油のみからなることができる。

【0055】本発明に従って使用できるシリコン油としては、シクロメチコン（オクタメチルシクロテトラシロキサン）が好都合に使用される。しかし、その他のシリコン油、例えばヘキサメチルシクロトリシロキサン、ポリジメチルシロキサン及びポリ（メチルフェニルシロキサン）もまた本発明の範疇内で好都合に使用できる。

【0056】シクロメチコンとイソノナン酸イソトリデシルの混合物及び、シクロメチコンとイソステアリン酸2-エチルヘキシルの混合物は更に特に好都合である。

【0057】本発明による調製物の水性相は、適当なら、好都合には、

ー それぞれ単独で又は組み合わせて使用される、低C数のアルコール、ジオール又はポリオール及びそれらのエーテル、好ましくはエタノール、イソプロパノール、プロピレングリコール、グリセロール、エチレングリコール、エチレングリコールモノエチルもしくはモノブチルエーテル、プロピレングリコールモノメチル、モノエチルもしくはモノブチルエーテル、ジエチレングリコールモノメチルもしくはモノエチルエーテル及び類似の製品、並びに更に低C数のアルコール、例えばエタノール、イソプロパノール、1, 2-プロパンジオール及びグリセロール、並びに、特に、好都合には二酸化ケイ素、ケイ酸アルミニウム、多糖及びそれらの誘導体、例えばヒアルロン酸、キサンタンゴム及びヒドロキシプロピルメチルセルロースからなる群から、特に好都合にはポリアクリレート、好ましくは、いわゆるカーボボール類、例えば980、981、1382、2984及び5984タイプのカーボボールからなる群からのポリアクリレートからなる群から選ぶことができる、1種類以上の増粘剤を含んでなる。

【0058】化粧品又は皮膚科学的光線防御調製物は好都合には、例えば調製物の総重量の0.1重量%から3

10

20

30

40

50

0重量%の量の、好ましくは0.5重量%から10重量%の量の、しかし特には1重量%から6重量%の量の無機顔料、特には微細顔料を含んでなる。

【0059】本発明による組み合わせ物に加えて、その脂質相中に油性UV Aフィルター及び/又はUV Bフィルター、並びに/あるいは水性相中に水性UV Aフィルター及び/又はUV Bフィルターを使用することは、本発明に従って好都合である。

【0060】本発明による光線防御調製物は好都合には、UV B領域のUV光線を吸収するその他の物質を含んでなることができ、そのフィルター物質の総量は、全領域の紫外線から皮膚を防護する化粧品調製物を提供するためには、例えば、調製物の総重量の0.1重量%から30重量%、好ましくは0.5から10重量%、特には1から6重量%である。それらはまた日焼け止め用組成物としても使用することができる。

【0061】その他のUV Bフィルターは油性でも水溶性でもよい。好都合な油性UV Bフィルター物質は、例えば：

- 3-ベンジリデンカンファー誘導体、好ましくは3- (4-メチルベンジリデン) カンファー及び3-ベンジリデンカンファー；
- 4-アミノ安息香酸誘導体、好ましくは4- (ジメチルアミノ) 安息香酸2-エチルヘキシル及び4- (ジメチルアミノ) 安息香酸アミル；
- ケイ皮酸のエステル、好ましくは4-メトキシケイ皮酸2-エチルヘキシル及び4-メトキシケイ皮酸イソペンチル；
- ベンゾフェノンの誘導体、好ましくは2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン、2-ヒドロキシ-4-メトキシ-4'-メチルベンゾフェノン及び2, 2'-ジヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン；
- ベンザルマロン酸のエステル、好ましくは4-メトキシベンザルマロン酸ジ (2-エチルヘキシル) である。

【0062】好都合な水溶性のUV Bフィルター物質は、例えば：

- \* — 2-フェニルベンズイミダゾール-5-スルホン酸の塩、例えばそのナトリウム、カリウム又はそのトリエタノールアンモニウム塩、及びスルホン酸自体；
- ベンゾフェノンのスルホン酸誘導体、好ましくは2-ヒドロキシ-4-メトキシベンゾフェノン-5-スルホン酸及びその塩；
- 3-ベンジリデンカンファーのスルホン酸誘導体、例えば、4- (2-オキソ-3-ボルニリデンメチル) ベンゼンスルホン酸、2-メチル-5- (2-オキソ-3-ボルニリデンメチル) ベンゼンスルホン酸及びそれらの塩である。

【0063】本発明による活性化化合物組み合わせ物と組み合わせ使用することができる前記の更なるUV Bフィルターのリストはもちろん、それらに限定することを意図されていない。

【0064】本発明による組み合わせ物を、今日まで化粧品調製物中に通常含有されてきた更なるUV Aフィルターと組み合わせることもまた好都合であるかもしれない。これらの物質は好ましくは、ジベンジルメタンの誘導体、特に1- (4'-tert-ブチルフェニル) -3- (4'-メトキシフェニル) プロパン-1, 3-ジオン及び1-フェニル-3- (4'-イソプロピルフェニル) プロパン-1, 3-ジオンである。本発明はまたこれらの組み合わせ物、及びこれらの組み合わせ物を含んでなる調製物に関する。UV B組み合わせ物に対して使用された量を使用することができる。

【0065】本発明による活性化化合物組み合わせ物をその他のUV A及び/又はUV Bフィルターと組み合わせることは更に好都合である。

【0066】以下の実施例は本発明を限定することなしに具体的に説明することを意図している。すべての量のデータ、含有量及び含有百分率は、特記されない限り、調製物の重量及び総量、又は総重量を基にしている。

#### 【0067】

#### 【実施例】

#### (実施例1)

\*

#### サンクリームO/W

	重量%
シクロメチコン	3.00
ステアリン酸グリセリル+PEG 30-ステアラート	2.00
羊毛ワックスアルコール	0.10
ステアリン酸グリセリル	3.00
パルミチン酸イソプロピル	2.00
オクチルドデカノール	1.00
安息香酸C <sub>12-15</sub> -アルキル	2.00
グリセロール	3.00
セチルアルコール	3.00
ミリスチン酸ミリスチル	2.00
メチルベンジリデンカンファー	2.00



13

14

(実施例2)

10

メトキシケイ皮酸オクチル	4.50
ブチルメトキシジベンゾイルメタン	2.00
Uvinul T 150	2.00
酢酸トコフェリル	0.50
EDTA溶液 (20重量%)	0.50
エチルアルコール	4.00
保存剤	適量
香料	適量
水、完全に脱塩化	全100.00

サンクリームO/W

重量%

シクロメチコン	3.00
ステアリン酸グリセリル+PEG 30-ステアレート	2.00
ステアリン酸グリセリル	3.00
パルミチン酸イソプロピル	2.00
オクチルドデカノール	3.00
グリセロール	3.00
セチルアルコール	3.00
酢酸トコフェリル	0.50
メトキシケイ皮酸オクチル	4.50
メチルベンジリデンカンファー	0.50
Uvinul T 150	1.50
PVP/ヘキサデセン・コポリマー	1.50
EDTA溶液 (20重量%)	0.50
NaOH	適量
エチルアルコール	1.50
保存剤	適量
香料	適量
水、完全に脱塩化	全100.00

(実施例3)

サンミルクO/W

重量%

4-リン酸トリラウレス	0.75
4-リン酸トリセアレス	1.00
ステアリン酸グリセリル+PEG 100-ステアレート	1.00
ステアリン酸グリセリル+セアレス 20	0.80
ラノリン酸グリセリル	0.50
パルミチン酸イソプロピル	3.00
カプリル酸/カプリン酸グリセロール	
(「カプリル酸/カプリン酸トリグリセリド」)	5.00
セチルアルコール	1.00
Uvinul T 150	1.50
メトキシケイ皮酸オクチル	6.00
メチルベンジリデンカンファー	3.00
PVP/エイコセン・コポリマー	1.00
ブチルヒドロキシトルエン	0.06
EDTA溶液 (20重量%)	0.50
NaOH	適量
保存剤	適量

(実施例4)	15	
	水、完全に脱塩化	全100.00
		重量%
	ステアリン酸グリセリルSE	4.00
	ステアリン酸	2.00
	安息香酸C <sub>12-15</sub> -アルキル	5.00
	カプリル酸/カプリン酸トリグリセリド	5.00
	オクチルドデカノール	5.00
	ブチレングリコール	5.00
	セテアリルアルコール	0.50
	カーボマー	0.20
	ブチルメトキシジベンゾイルーメタン	2.00
	メチルベンジリデンカンファー	4.00
	Uvinul T 150	1.00
	酢酸トコフェリル	1.00
	フルフリリデンソルビトール	0.50
	シクロメチコン	2.00
	Na <sub>3</sub> HEDTA	1.00
	水酸化ナトリウム (45%濃度)	0.25
	保存剤	適量
	香料	適量
	水、完全に脱塩化	全100.00

(実施例5)		
		重量%
	ステアリン酸グリセリル SE	4.00
	ステアリン酸	2.00
	安息香酸C <sub>12-15</sub> -アルキル	5.00
	カプリル酸/カプリン酸トリグリセリド	5.00
	オクチルドデカノール	5.00
	グリセロール	5.00
	セテアリルアルコール	0.50
	カーボマー	0.20
	ブチルメトキシジベンゾイルーメタン	2.00
	メチルベンジリデンカンファー	4.00
	Uvinul T 150	1.50
	酢酸トコフェリル	1.00
	フルフリリデンソルビトール	0.50
	シクロメチコン	2.00
	Na <sub>3</sub> HEDTA	1.00
	水酸化ナトリウム (45%濃度)	0.25
	保存剤	適量
	香料	適量
	水、完全に脱塩化	全100.00

(実施例6)		
		重量%
	ステアリン酸グリセリル SE	4.00
	ステアリン酸	2.00
	安息香酸C <sub>12-15</sub> -アルキル	5.00
	カプリル酸/カプリン酸トリグリセリド	5.00
	オクチルドデカノール	5.00

17	
ブチレングリコール	5.00
セテアリルアルコール	0.50
カーボマー	0.20
ブチルメトキシジベンゾイルーメタン	2.00
メチルベンジリデンカンファア	4.00
Uvinul T 150	1.50
酢酸トコフェリル	1.00
フルフリリデンソルビトール	0.50
シクロメチコン	2.00
Na <sub>3</sub> HEDTA	1.00
水酸化ナトリウム (45%濃度)	0.25
保存剤	適量
香料	適量
水、完全に脱塩化	全100.00

(実施例7)

	重量%
ステアリン酸グリセリル SE	4.00
ステアリン酸	2.00
安息香酸C <sub>12-15</sub> -アルキル	5.00
鉱油	5.00
オクチルドデカノール	5.00
グリセロール	5.00
セテアリルアルコール	0.50
カーボマー	0.20
ブチルメトキシジベンゾイルーメタン	2.00
メチルベンジリデンカンファア	4.00
Uvinul T 150	1.50
酢酸トコフェリル	1.00
フルフリリデンソルビトール	0.50
シクロメチコン	2.00
Na <sub>3</sub> HEDTA	1.00
水酸化ナトリウム (45%濃度)	0.25
保存剤	適量
香料	適量
水、完全に脱塩化	全100.00

(実施例8)

	重量%
ステアリン酸グリセリル SE	4.00
ステアリン酸	2.00
安息香酸C <sub>12-15</sub> -アルキル	5.00
カプリン酸/カプリル酸トリグリセリド	5.00
オクチルドデカノール	5.00
ブチレングリコール	5.00
セテアリルアルコール	0.50
カーボマー	0.20
ブチルメトキシジベンゾイルーメタン	2.00
メチルベンジリデンカンファア	4.00
Uvinul T 150	2.00
酢酸トコフェリル	1.00
フルフリリデンソルビトール	0.50

19	
シクロメチコン	2.00
Na <sub>3</sub> HEDTA	1.00
水酸化ナトリウム (45%濃度)	0.25
保存剤	適量
香料	適量
水、完全に脱塩化	全100.00

20

(実施例9)

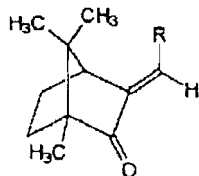
	重量%
ステアリン酸グリセリル SE	4.00
ステアリン酸	2.00
安息香酸C <sub>12-15</sub> -アルキル	5.00
カプリン酸/カプリル酸トリグリセリド	5.00
オクチルドデカノール	5.00
ブチレングリコール	5.00
セテアリルアルコール	0.50
カーボマー	0.20
ブチルメトキシジベンゾイルーメタン	2.00
メチルベンジリデンカンファー	4.00
Uvinul T 150	2.00
酢酸トコフェリル	1.00
フルフリリデンソルビトール	0.50
シクロメチコン	2.00
Na <sub>3</sub> HEDTA	1.00
水酸化ナトリウム (45%濃度)	0.25
保存剤	適量
香料	適量
水、完全に脱塩化	全100.00

本発明の特徴と態様を以下に示す。

【0068】1. (a) 孤立した油成分中、又は  
(b) 更に1種類以上の水性相を含んでなることがで  
きる、分散された二相もしくは多相系の少なくとも1種  
類の油性相中のいずれかにおいて、4, 4', 4'' -  
(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリ  
イミノ) トリス安息香酸・トリス (2-エチルヘキシ  
ル) の溶解度を達成又は増加させるための、一般構造

【0069】

【化6】



【0070】〔式中、Rは5個までのアルキル基により  
置換されているか又は非置換のアリール基である〕のカ  
ンファー誘導体の使用。

【0071】2. (a) 孤立した油成分中、又は  
(b) 更に1種類以上の水性相を含んでなることがで  
きる、分散された二相もしくは多相系の少なくとも1種  
類の油性相中、のいずれかにおいて、4, 4', 4'' -

(1, 3, 5-トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリ  
イミノ) トリス安息香酸・トリス (2-エチルヘキシ  
ル) の溶液を安定化させる方法であって、本発明に従っ  
て使用される、活性量の1種類以上のカンファー誘導体  
を、(a) その中で 4, 4', 4'' - (1, 3, 5-  
トリアジン-2, 4, 6-トリイルトリイミノ) トリ  
ス安息香酸・トリス (2-エチルヘキシル) が溶解形態  
で存在する、孤立した油成分中に、又は (b) その中  
で 4, 4', 4'' - (1, 3, 5-トリアジン-2,  
4, 6-トリイルトリイミノ) トリス安息香酸・トリス  
(2-エチルヘキシル) が溶解形態で存在する、分散さ  
れた二相もしくは多相系の少なくとも1種類の油性相  
中、のいずれかに添加し、その際、前記二相もしくは多  
相系は更に1種類以上の水性相を含んでなることができ  
る、ことを特徴とする方法。

【0072】3. 完成した化粧品又は皮膚科学的調製  
物中の 4, 4', 4'' - (1, 3, 5-トリアジン-  
2, 4, 6-トリイルトリイミノ) トリス安息香酸・ト  
リス (2-エチルヘキシル) の総量が、それぞれ、調製  
物の総重量の0.1~10.0重量%、好ましくは0.  
5~6.0重量%の範囲から選ばれることを特徴とす  
る、第1項記載の使用又は第2項記載の方法。

【0073】4. 完成した化粧品又は皮膚科学的調製

物中の本発明により使用される１種類以上のカンファ－誘導体の総量が、それぞれ、調製物の総重量の０．１～１５．０重量％、好ましくは０．５～８．０重量％の範囲から選ばれることを特徴とする、第１項記載の使用又は第２項記載の方法。

【００７４】５． ４，４′，４″－（１，３，５－トリアジン－２，４，６－トリイルトリイミノ）トリス安息香酸・トリス（２－エチルヘキシル）と１種類以上のカンファ－誘導体の重量比が、１：８から４：１、好ま

しくは１：４から２：１、特に好ましくは１：２から１：１の範囲から選ばれることを特徴とする、第１項記載の使用又は第２項記載の方法。

【００７５】６． 更に１種類以上の水性相を含んでなることができる、分散された二相もしくは多相系が、化粧品又は皮膚科学的エマルジョン、例えばＷ／Ｏ、Ｏ／Ｗ、Ｗ／Ｏ／Ｗ又はＯ／Ｗ／Ｏ型のエマルジョンの形態で存在することを特徴とする、第１項記載の使用又は第２項記載の方法。